

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2001-114632

(43)Date of publication of application : 24.04.2001

(51)Int.Cl.

A61K 7/00

A61K 7/42

(21)Application number : 2000-292723

(71)Applicant : L'OREAL SA

(22)Date of filing : 26.09.2000

(72)Inventor : RUBINSTENN GILLES
GUIRAMAND CAROLE
BALDO FRANCINE
DREHER SUSANNE

(30)Priority

Priority number : 1999 9912828

Priority date : 14.10.1999

Priority country : FR

(54) SAPOGENIN-CONTAINING COMPOSITION, ESPECIALLY COSMETIC COMPOSITION

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a physiologically acceptable composition by dissolving diosgenin and another sapogenin having a similar structure in a composition containing sapogenin in a sufficient amount to provide the composition with a desired effect at room temperature in an enough period to provide the composition with a right storage state.

SOLUTION: This composition comprises at least one sapogenin and a dissolution system of (a) at least one nonemulsified ester of a fatty acid whose hydrocarbon base chain containing at least 8 carbon atoms and/or a fatty alcohol whose hydrocarbon base chain containing at least 8 carbon atoms or a vegetable oil and (b) at least one branched fatty alcohol whose hydrocarbon base chain containing at least 8 carbon atoms and/or a fat-soluble UV screening agent in a physiologically acceptable medium.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 26.09.2000

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 06.07.2004

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number] 3646148

[Date of registration] 18.02.2005

[Number of appeal against examiner's decision of rejection] 2004-20503

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection] 04.10.2004
[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号
特開2001-114632
(P2001-114632A)

(43) 公開日 平成13年4月24日 (2001.4.24)

(51) Int.Cl. ⁷ A 6 1 K 7/00	識別記号	F I A 6 1 K 7/00	データベース (参考) G C D E
7/42		7/42	
		審査請求 有	請求項の数16 O L (全 12 頁)

(21) 出願番号	特願2000-292723 (P2000-292723)	(71) 出願人	391023932 ロレアル LOREAL フランス国パリ, リュ ロワイヤル 14
(22) 出願日	平成12年9月26日 (2000.9.26)	(72) 発明者	ジル・ルバンスタン フランス・75013・パリ・リュ・パロー・ 28
(31) 優先権主張番号	9 9 1 2 8 2 8	(72) 発明者	カロール・ギラマン フランス・91310・リナ・リュ・サン・ヴ アンサン・19
(32) 優先日	平成11年10月14日 (1999.10.14)	(74) 代理人	100064908 弁理士 志賀 正武 (外7名)
(33) 優先権主張国	フランス (F R)		
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 サボゲニンを含む組成物、特に化粧品組成物

(57) 【要約】

【課題】 所望の効果をを得るのに十分な量で、室温でサボゲニンを含む組成物に正しい貯蔵状態を与えるのに十分な期間、ジオスゲニン及び同様な構造の他のサボゲニンを溶解する生理学的に許容可能な手段の提供。

【解決手段】 生理学的に許容可能な媒体中に、少なくとも一つのサボゲニンと (a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸の、及び/またはその炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、並びに (b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、及び/または少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤を含む溶解系とを含む組成物を提供すること。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 生理学的に許容可能な媒体中に、少なくとも一つのサボゲニンと以下のもの：

(a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸の、及び／またはその炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、並びに(b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、及び／または少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤を含む溶解系とを含む組成物。

【請求項2】 上記エステルが、分枝した脂肪アルコールの及び／または分枝した脂肪酸のモノエステルであることを特徴とする、請求項1記載の組成物。

【請求項3】 上記エステルが、イソノナン酸イソノニル、ネオペンタン酸イソデシル、ネオペンタン酸オクチルドデシル、イソステアリン酸イソステアリル、及びステアリン酸イソセチルから選択されることを特徴とする、請求項2記載の組成物。

【請求項4】 上記エステルが、モノカルボン酸脂肪酸とグリセリンとのトリエステルであることを特徴とする、請求項1記載の組成物。

【請求項5】 上記エステルが、上記組成物の全重量に対して5から15%を占めることを特徴とする、請求項1から4のいずれか一項記載の組成物。

【請求項6】 上記分枝した脂肪アルコールが、ゲルベアルコールであることを特徴とする、請求項1から5のいずれか一項記載の組成物。

【請求項7】 上記ゲルベアルコールが、ブチルオクタノール、ヘキシルデカノール、オクチルデカノール、イソステアリルアルコール、オクチルドデカノール、デシルテトラデカノール、ウンデシルペンタデカノール、ドデシルヘキサデカノール、テトラデシルオクタデカノール、ヘキシルデシルオクタデカノール、テトラデシルエイコサノール、及びセチルアラキドールから選択されることを特徴とする、請求項6記載の組成物。

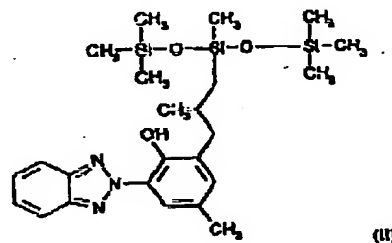
【請求項8】 上記脂肪アルコールが、上記組成物の全重量に対して0.1から30%を占めることを特徴とする、請求項1から7のいずれか一項記載の組成物。

【請求項9】 上記脂溶性UVスクリーニング剤が、p-アミノ安息香酸エステル、塩またはアミドのような、p-アミノ安息香酸誘導体；サリチル酸エステルまたは塩のようなサリチル酸誘導体；ベンゾフェノン誘導体；ジベンゾイルメタン誘導体；ジフェニルアクリレート誘導体；ベンゾフラン誘導体；一つ以上の有機ケイ素残基を含むポリマー状UVスクリーニング剤；ケイ皮酸エステル；カンファー誘導体；トリアニリノ-s-トリアジン誘導体；フェニルベンズイミダゾールスルホン酸及びその塩；ウロカニン酸またはそのエチルエステル；ベンゾトリアゾール；ヒドロキシフェニルトリアジン誘導体；ビ

ス-レゾルシノール-ジアルキルアミノトリアジン；並びにそれらの混合物から選択される、請求項1から8のいずれか一項記載の組成物。

【請求項10】 上記脂溶性スクリーニング剤が、サリチル酸オクチル；ベンゾフェノン-3；ブチルメトキシジベンゾイルメタン；オクトクリレン；メトキシケイ皮酸オクチル；及び以下の式(II)の化合物：

【化1】



から選択されることを特徴とする、請求項9記載の組成物。

【請求項11】 上記スクリーニング剤が、上記組成物の全重量に対して1から10%を占めることを特徴とする、請求項1から10のいずれか一項記載の組成物。

【請求項12】 その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸及び／または脂肪アルコールの少なくとも一つの乳化していないエステルと、その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコールと、少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤とを含む溶解系を含むことを特徴とする、請求項1から11のいずれか一項記載の組成物。

【請求項13】 上記サボゲニンが、ジオスゲニン、ヘコゲニン、スミラゲニン、サルサボゲニン、チゴゲニン、ヤモゲニン、及びユカゲニンから選択されることを特徴とする、請求項1から12のいずれか一項記載の組成物。

【請求項14】 上記サボゲニンがジオスゲニンであることを特徴とする、請求項13記載の組成物。

【請求項15】 0.001から10重量%、好ましくは0.05から5重量%のサボゲニンを含むことを特徴とする、請求項1から14のいずれか一項記載の組成物。

【請求項16】 サボゲニンを、以下のもの：

(a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸の、及び／またはその炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、並びに(b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、及び／または少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤を含む溶解系と混合することにより成る工程を含むことを特徴とする、サボゲニンの溶解法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、生理学的に許容可能な媒体中に、少なくとも一つのサボゲニンを含む組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】サボゲニンは、植物界に存在する非常に高分子量のヘテロシドである、サボノシドの酸加水分解から生ずる化合物である。

【0003】例示されるサボゲニンとして特に、ジオスゲニン、ヘコゲニン、スミラゲニン、サルサボゲニン、チゴゲニン、ヤモゲニン、及びユカゲニンが挙げられる。

【0004】これらの化合物は、可変的な数のヒドロキシル及び／若しくはオキシ置換基、及び／または可変的な数の二重結合を含むステロイド構造を一般的に有する。それらは、ステロイドホルモンの天然化学的前駆体として周知であり、この観点から、各種の化粧品または製薬学的調製物の選択の要素として記載されている。文献US-5 827 884はまた、抗炎症特性について並びに細胞増殖刺激因子としてのこれらの化合物の使用を開示する。

【0005】好ましいサボゲニンは、コロハまたは各種のDioscorea植物、例えば野生のヤムイモの根から抽出できる、ジオスゲニンまたはスピロスト-5-エン-3-ベーターオールである。

【0006】しかしながら、ジオスゲニンは、局所的適用のために生理学的に許容可能な溶媒中には、その高い融点（204-207℃近傍）及びこれらの溶媒中での再結晶化の傾向を有するために、溶解するのが困難であり、かくして製剤化するのが困難である。

【0007】

【発明が解決しようとする課題】かくして本発明の目的は、所望の効果を有するのに十分な量で、室温でサボゲニンを含む組成物に正しい貯蔵状態を与えるのに十分な期間、ジオスゲニン及び同様な構造の他のサボゲニンを溶解する生理学的に許容可能な手段を提案することである。

【0008】ここで本出願人は、特異的な溶解系の使用が、この目的を達成できることを発見した。

【0009】

【課題を解決するための手段】かくして本発明の主題は、生理学的に許容可能な媒体中に、少なくとも一つのサボゲニンと以下のものを含む溶解系とを含む組成物である：

(a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸の、及び／またはその炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、並びに(b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも

8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、及び／または少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤。

【0010】

【発明の実施の形態】本発明者は、ポリソルバートのような乳化したエステルはサボゲニンを溶解しないが、C₁₂₋₁₅安息香酸アルキルまたはヒマシ油のような、特定の乳化していない脂肪アルコール及び／または脂肪酸のエステルは、それ自体単独によって、サボゲニン及び溶媒の全重量に対して、3重量%までの範囲のサボゲニンの量を溶解可能であることを示した。しかしながら、得られた溶液は、3日後に再結晶化した。オクチルドデカノールのような特定の分枝した脂肪アルコール、並びにメトキシケイ皮酸オクチルを含む特定の脂溶性UVスクリーニング剤中で、少なくとも7日間再結晶化することなく、2%までに制限されたサボゲニンの量を溶解することもまた示された。

【0011】しかしながら、これらの最初の結果は、サボゲニンの商業的な使用に対しては利用するのが困難であった。さらに、脂溶性UVスクリーニング剤と脂肪アルコールは、それ自体適切なサボゲニンの溶媒であるが、皮膚への局所的適用のための製品中での大量の使用は推奨されない。これについての理由は、スクリーニング剤が比較的高価であるためである。さらに、それらは質感の点でこれらの組成物の製剤化の自由を制限するといった、それらを含む組成物のレオロジーに強力な影響を有する。その一部としての脂肪アルコールは、刺激性であり、皮膚を乾燥するという傾向を有する。

【0012】本発明は、少なくとも一つの以下の効果（個々に得られた化合物に相対的に）を得るという意味で、これらの溶解化合物の二つの特定の組み合わせが、サボゲニンの溶解化に共同作用を与えるという発見に基づく：

- 溶解温度を低下する、
- 結晶化を遅らせる、または妨げさせる、
- 溶解されるサボゲニンの量を増大する。

【0013】かくしてこの共同作用は、植物油、または脂肪アルコールの、及び／若しくは分枝した脂肪アルコールを有する脂肪酸の、乳化していないエステルの組み合わせについて、並びに脂溶性UVスクリーニング剤とのこのエステルの組み合わせについて示された。これらの組み合わせはまた、ジオスゲニンを溶解するのに必要とされる脂肪アルコールまたはスクリーニング剤の量を、組成物について考慮される質感の型の選択に関して十分な範囲を製剤に与えるエステルで、上記剤の幾つかを置換することによって、減少するという利点を有する。脂肪アルコール及び／または脂肪酸の乳化していないエステルはまた、良好な皮膚軟化特性を有し、比較的成本を低下するという利点を有する。

【0014】かくして、本発明に従った組成物は、上述

の化合物のペアの少なくとも一つを含むことが必要であり、且つそれで十分である。しかしながら、化粧品での理由のため、これらの三つの溶解剤の3種の混合物を使用することは、場合により有利であろう。

【0015】かくして、一つの好ましい実施態様として、本発明に従った組成物は、以下のものを含む溶解系を含む：(a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸及び／若しくは脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、(b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む、少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、並びに(c) 少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤。

【0016】サポゲニン、以下のものから選択される：ジオスゲニン、ヘコゲニン、スミラゲニン、サルサポゲニン、チゴゲニン、ヤモゲニン、及びユカゲニン。

【0017】しかしながら本発明は、とりわけジオスゲニンに関する。この化合物は、以下の工程を連続的に含む方法によって、Dioscorea塊茎から抽出できる：鉍物酸媒体中でのヘテロシドの加水分解（任意に塊茎の発酵及び乾燥の後）；並びに不溶性画分の汜過、次いで非極性溶媒中での中和、洗浄及び処理。しかしながら、他の抽出方法も使用できる。ジオスゲニンはまた、Diosgeninの商標名の下でSigma社から商業的に入手可能である。

【0018】サポゲニンは、本発明に従った組成物の全重量の0.001から10%、好ましくは0.05から5%を占めることができる。

【0019】本発明に従った溶解系の構成は、より詳細に記載されるであろう。

【0020】脂肪酸及び／または脂肪アルコールの乳化していないエステル

本発明に従った溶解系の第一の構成成分を形成するエステルは、その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸から、及び／またはその炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪アルコールから得られる、モノ、ジまたはトリエステルであり得る。このエステルは乳化特性を有さない、即ち、それは一般的に、例えばそれに両親媒性性質を与えるに足る、オキシアルキル化基または硫酸基またはリン酸基のような極性基を有さない。

【0021】好ましく使用されるモノエステルは、分枝した脂肪アルコール及び／または分枝した脂肪酸のモノエステルである。脂肪酸および脂肪アルコールの両者が分枝していることが、より有利である。上記エステルの例は以下のものである：イソノナン酸イソノニル、ネオペンタン酸イソデシル、ネオペンタン酸オクチルドデシル、イソステアリン酸イソステアリル、及びステアリン酸イソセチル。しかしながら変形例として、本発明に従ったモノエステルを形成するアルコール及び／または酸の脂肪鎖は、ミリスチン酸イソプロピルの場合直鎖状で

あり得る。

【0022】使用できるジエステルは、ジカプリル酸プロピレングリコール及びジイソステアリン酸プロピレングリコールのような、モノカルボン酸とジオールとのジエステルを含む。

【0023】有利に使用されるトリエステルは、モノカルボン酸脂肪酸とグリセリンとのトリエステルを含む。例として、トリイソステアリン酸グリセリルまたはカプリル酸／カプリン酸トリグリセリドが挙げられる。

【0024】変形例として、本発明に従った脂肪酸及び／または脂肪アルコールの乳化していないエステルは、アンズ実油、ヒマシ油、ヒマワリ油、グランドナッツ油、グレープシード油、クルミ油等のような植物油で置換できる。

【0025】本発明に従ったエステルまたは植物油は、組成物の全重量に対して、0.1から80重量%、好ましくは1から50重量%、より好ましくは5から15重量%の割合で使用できる。

【0026】分枝した脂肪アルコール

本発明に従った溶解系の第二の構成要素として使用できる化合物の一つを構成する分枝した脂肪アルコールは、

その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含むようなものである。それは好ましくは、ゲルベ(Guerbet)アルコールまたは2-アルキルアルコールである。

【0027】使用できるゲルベアルコールの例は、以下のものである：ブチルオクタノール、ヘキシルデカノール、オクチルデカノール、イソステアリルアルコール、オクチルドデカノール、デシルテトラデカノール、ウンデシルペンタデカノール、ドデシルヘキサデカノール、テトラデシルオクタデカノール、ヘキシルデシルオクタデカノール、テトラデシルエイコサノール、及びセチルアラキドール。ヘキシルデカノールが好ましく使用される。

【0028】本発明に従った脂肪アルコールは通常、組成物の全重量に対して0.1から30%、好ましくは1から25%、より好ましくは1から20%を占める。

【0029】脂溶性UVスクリーニング剤

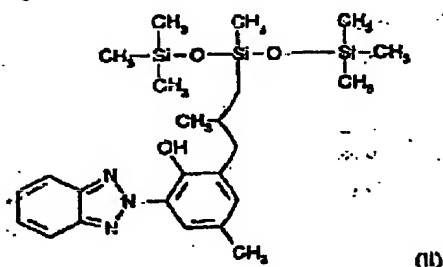
本発明に従った溶解系中の第二の構成要素は、上述の脂肪アルコールの代わりにまたはそれに加えて、脂溶性UVスクリーニング剤より成ることができる。

【0030】本発明において使用に適した脂溶性サンスクリーンとして、特に以下のものが挙げられる：p-アミノ安息香酸エステル、塩またはアミドのような、p-アミノ安息香酸誘導体；サリチル酸エステルまたは塩のようなサリチル酸誘導体；ベンゾフェノン誘導体；ジベンゾイルメタン誘導体；ジフェニルアクリレート誘導体；ベンゾフラン誘導体；一つ以上の有機ケイ素残基を含むポリマー状UVスクリーニング剤；ケイ皮酸エステル；カンファー誘導体；トリアニリノ-s-トリアジン誘導体；

フェニルベンズイミダゾールスルホン酸及びその塩；ウロカニン酸またはそのエチルエステル；ベンゾトリアゾール；ヒドロキシフェニルトリアジン誘導体；ビス-レゾルシノール-ジアルキルアミノトリアジン；並びにそれらの混合物。

【0031】本発明に従った脂溶性サンスクリーンは好ましくは、以下のものから選択される：サリチル酸オクチル；ベンゾフェノン-3；ブチルメトキシジベンズイルメタン；オクトクリレン；メトキシケイ皮酸オクチル及び以下の式（I I）の化合物、または特許出願EP-A-0 392 883に記載された2-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル)-4-メチル-6-[2-メチル-3-{1,3,3,3-テトラメチル-1-[(トリメチルシリル)オキシ]ジシロキサンル}プロピニル]フェノール：

【化2】



【0032】本発明で使用する脂溶性UVスクリーニング剤の量は、溶解されるサボゲニンの量、及び上述の他の共溶媒の量に依存するだけでなく、組成物の与えることが望ましい日光保護因子（SPF）の関数である。かくしてスクリーニング剤は、組成物の全重量の0.001から30%を占める。組成物が毎日のスキンケアで企図される場合、組成物の全重量の1から10%を占めるUVスクリーニング剤の量が好ましく使用される。

【0033】本発明に従った組成物は、特に油性溶液、水中油型若しくは油中水型若しくは複相エマルジョン、シリコーンエマルジョン、マイクロエマルジョン若しくはナノエマルジョン、油性ゲル、液体、ペースト状若しくは固体無水製品、小球の存在下での水相中の油の分散物で、これらの小球がナノスフェア及びナノカプセルのようなポリマー状ナノ粒子であり得るもの、またはより好ましくは、イオン性及び／若しくは非イオン性タイプの液体ビヒクルの形態で、皮膚への局所的適用のために通常使用される何れかの製薬学的形態で存在できる。

【0034】この組成物は多かれ少なかれ液体であり得、白色若しくは無色のクリーム、軟膏、乳液、ローション、セラム、ペースト、ムースまたはゲルの外観を有してもよい。それは任意に、エアゾールの形態で皮膚に適用できる。それはまた、子体形態、及び例えばスティックの形態で存在できる。それは、ケア製品として、及び／または皮膚のためのメイクアップ製品として、または例えばシャンプー若しくはコンディショナーのよう

なヘア製品として使用できる。

【0035】周知の態様として、本発明の組成物はまた、親水性若しくは脂溶性ゲル化剤、親水性若しくは脂溶性活性剤、防腐剤、抗酸化剤、溶媒、香料、フィラー、顔料、親水性スクリーニング剤、脱臭剤及び染料のような、化粧品及び皮膚科学で一般的であるアジュバントを含むことができる。これらの各種のアジュバントの量は、例えば組成物の全重量に対して0.01から20%といった、考慮される分野で従来使用されているものである。その性質に依存して、これらのアジュバントは、脂肪相、水相、脂質ビヒクル、及び／またはナノ粒子内に取り込ませることができる。

【0036】本発明に従った組成物がエマルジョンである場合、脂肪相の割合は、組成物の全重量に対して5から80重量%、好ましくは5から50重量%の範囲であり得る。

【0037】本発明で使用する脂肪物質として、上述の溶解系に加えて、鉱物油、動物起源の油、合成油、シリコーン油、及びフルオロ油を使用可能である。使用できる脂肪物質は、脂肪酸、ワックス及びゴム、特にシリコーンゴムを含む。しかしながら、サボゲニンに対してカウンター溶媒として機能する傾向を有するため、水素化ポリイソブテンの使用は推奨されず、液体パラフィン及びワセリンの使用も好ましくない。

【0038】エマルジョン形態の組成物で任意に使用される乳化剤及び共乳化剤は、考慮される分野で従来使用されるものから選択される。これらの乳化剤及び共乳化剤は好ましくは、組成物の全重量に対して、0.3から30重量%、好ましくは0.5から20重量%の範囲の割合で組成物中に存在する。本発明で使用する乳化剤及び共乳化剤として、PEG-100ステアラート、PEG-50ステアラート及びPEG-40ステアラート；例えばTween（登録商標）20またはTween（登録商標）60の商標名の下で入手可能な、ソルビタントリステアラート、オキシエチレン化ソルビタンスステアラートのような、脂肪酸とポリオールとのエステル；並びにこれらの混合物を使用することが特に有利である。

【0039】特に例示される親水性ゲル化剤は、カルボキシビニルポリマー（カーボマー）、アクリル酸／アルキルアクリル酸コポリマーのようなアクリル酸コポリマー、ポリアクリルアミド、ポリサッカリド、天然ゴム及びクレーであり、脂溶性ゲル化剤として、ベントンのような修飾クレー、脂肪酸の金属塩、及び親油性シリカが挙げられる。

【0040】特に使用できる活性剤は、脱色素剤、皮膚軟化剤、保湿剤、抗脂漏剤、抗挫瘡剤、髪の再生を促進するための剤、角質溶解剤及び／または剥離剤、抗シワ剤、抗刺激剤及び静穏剤、並びにこれらの混合物を含む。

【0041】各々またはサボゲニンと不適合である場合、上述の活性剤及び／またはサボゲニンは、組成物中で各々から隔離するために、小球、特にイオン製若しくは非イオン性ビヒクル及び／またはナノ粒子（ナノカプセル及び／またはナノスフェア）内に取り込まれ得る。

【0042】言うまでもなく、当業者は、本発明に従った組成物に本来に関連する有利な特性が、考慮される添加剤によって負に影響されない、または実質的に負に影響されないように、本発明に従った組成物に加えられる最適化合物、並びにその濃度を選択するのに注意を払うであろう。特に、これらの化合物は、サボゲニンの有利な特性を損なわず、サボゲニンの再結晶化に助力すべきである。

【0043】本発明はまた、以下のもの：

(a) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む脂肪酸の及び／または脂肪アルコールの、少なくとも一つの乳化していないエステル、または植物油、並びに (b) その炭化水素ベースの鎖が少なくとも8の炭素原子を含む少なくとも一つの分枝した脂肪アルコール、及び／または少なくとも一つの脂溶性UVスクリーニング剤を含む溶解系と、サボゲニンとを混合することより成る工程を含むことを特徴とする、サボゲニンを溶解する方法に関する。

【0044】サボゲニンと溶解系との混合は一般的に、例えば70℃の領域の温度といった、高温条件下で実施される。

【0045】本発明は、以下の非制限的な実施例の助けを借りて説明されるであろう。

【0046】

【実施例】実施例1：分枝した脂肪酸のトリエステルとポリオール／分枝した脂肪アルコールとの混合物中への溶解

それぞれ異なる溶媒中にSigma社から得たジオスゲニンの2重量%を含む、三種の組成物を調製した：

組成物1A：この商標名でStearinerie Dubois社から入手可能なトリイソステアリン酸トリグリセリル。

組成物1B：Isofol 16の商標名でCondea社から入手可能なヘキシルデカノール。

組成物1C：トリイソステアリン酸トリグリセリルとヘキシルデカノールとの50/50混合物（重量比）。

【0047】上述の組成物を、以下の方法で調整した。100mgのジオスゲニンを量り取り、密閉ビルボックスに配置し、そこに4.9gの溶媒を、一時間以下で25℃で磁性攪拌しながら加えた。ジオスゲニンが一時間後に溶解しない場合、懸濁液を水浴中で50℃で攪拌しながら加熱し、さらにこの温度で一時間後ジオスゲニンの溶解が見られなかった場合、懸濁液の温度を70℃に上昇した。

【0048】得られた結果が、以下の表1に記載される。

【表1】

組成物	溶解温度	結晶化の遅延
1 A	不溶性	不溶性
1 B	70℃	3日
1 C	50℃	>15日*

★ 実験の継続時間

【0049】上記方法を、溶媒中に配置するジオスゲニンの量を変えて繰り返した。かくして、溶媒の混合物中に50℃で溶解できるジオスゲニンの最大の量は2%であり、一方で個々に得られた溶媒のそれぞれ中には1%のみであることが示された。

【0050】乳化していないエステルと分枝した脂肪アルコールとの混合物は、ジオスゲニンの溶解に関してこれらの化合物の効果に共同作用することが、上記発見から導かれる。

【0051】実施例2：直鎖状脂肪酸のモノエステルと、分枝した脂肪アルコール／分枝した脂肪アルコール

との混合物中への溶解

実施例1と同様な方法で、それぞれ異なる溶媒中にSigma社から得らジオスゲニンの2重量%を含む三種の組成物を調製した：

組成物2A：この商標名でStearinerie Dubois社から入手可能なミリスチン酸イソプロピル。

組成物2B：Isofol 16の商標名でCondea社から入手可能なヘキシルデカノール。

組成物2C：ミリスチン酸イソプロピルとヘキシルデカノールとの50/50（重量比）混合物。

【0052】得られた結果が、以下の表2に示される。

【表2】

組成物	溶解温度	結晶化の遅延
2 A	70℃	2日
2 B	70℃	3日
2 C	25℃	>15日*

★ 実験の継続時間

【0053】上記方法を、溶媒中に配置するジオスゲニンの量を変えて繰り返した。かくして、溶媒の混合物中に50℃で溶解できるジオスゲニンの最大の量は4%であり、一方で個々に得られた溶媒のそれぞれ中には1%のみであることが示された。

【0054】乳化していないエステルと分枝した脂肪アルコールとの混合物は、ジオスゲニンの溶解に関してこれらの化合物の効果に共同作用することが、上記発見から導かれる。

【0055】実施例3：分枝した脂肪アルコールのモノエステルと、分枝した脂肪酸／分枝した脂肪アルコール

組成物	溶解温度	結晶化の遅延
3 A	70℃	5時間
3 B	70℃	3日
3 C	40℃	>15日*

★ 実験の継続時間

【0057】上記方法を、溶媒中に配置するジオスゲニンの量を変えて繰り返した。かくして、溶媒の混合物中に50℃で溶解できるジオスゲニンの最大の量は3%であり、一方で個々に得られた溶媒のそれぞれ中には1%のみであることが示された。

【0058】乳化していないエステルと分枝した脂肪アルコールとの混合物は、ジオスゲニンの溶解に関してこれらの化合物の効果に共同作用することが、上記発見から導かれる。

【0059】実施例4：分枝した脂肪酸のモノエステルと、分枝した脂肪アルコール／脂溶性UVスクリーニン

組成物	溶解温度	結晶化の遅延
4 A	70℃	5時間
4 B	50℃	7日
4 C	50℃	7日

★ 実験の継続時間

【0061】次いで溶液中に配置されるジオスゲニンの量を変えた。かくして、溶媒の混合物中に50℃で溶解できるジオスゲニンの最大の量は3%であり、一方でエステル中では1%、UVスクリーニング剤中では2%のみであることが示された。

【0062】エステルとスクリーニング剤との混合物は、これらの溶媒中に溶解できるジオスゲニンの量に関して、これらの化合物の効果に共同作用することが、上

A1相

脱鈹物水	58.30%
防腐剤	0.25%
カーボマー	0.40%
グリセリン	3.00%
キサンタンゴム	0.10%

との混合物中への溶解

実施例1と同様な方法で、それぞれ異なる溶媒中にSigma社から得らジオスゲニンの2重量%を含む三種の組成物を調製した：

組成物3A：この商標名でStearinerie Dubois社から入手可能なイソノナン酸イソノニル。

組成物3B：Isofol 16の商標名でCondea社から入手可能なヘキシルデカノール。

組成物3C：イソノナン酸イソノニルとヘキシルデカノールとの50/50（重量比）混合物。

【0056】得られた結果が、以下の表3に示される。

【表3】

グ剤との混合物中への溶解

実施例1と同様な方法で、それぞれ異なる溶媒中にSigma社から得らジオスゲニンの2重量%を含む三種の組成物を調製した：

組成物4A：この商標名でStearinerie Dubois社から入手可能なイソノナン酸イソノニル。

組成物4B：Parsol MCXの商標名でGivaudan社から入手可能なメトキシケイ皮酸オクチル。

組成物4C：イソノナン酸イソノニルとメトキシケイ皮酸オクチルとの50/50（重量比）混合物。

【0060】得られた結果が、以下の表4に示される。

【表4】

記発見から導かれる。さらに、ジオスゲニンの2%の溶解が、溶媒の混合物中、及びスクリーニング剤単独中の両者で生じ、それによって低投与量でこのスクリーニング剤を使用することが可能であり、かくして組成物の化粧品特性及びその製造コストを改良することが可能である。

【0063】実施例5：化粧品組成物

以下の組成物を調製した：

A 2 相	
20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート (Polysorbate 60)	0.90%
B 相	
PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル	2.10%
セチルアルコール	2.60%
イソノナン酸イソノニル	11.50%
オクチルドデカノール	15.00%
ジオスゲニン	0.50%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
メトキシケイ皮酸オクチル	1.00%
防腐剤	0.15%
C 相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D 相	
脱鈹物水	1.50%
防腐剤	0.30%

【0064】A1相の構成成分を、攪拌しながら70℃で共に混合する。A2相及びB相の構成成分を共に混合し、水浴中で70℃で加熱し、次いで該混合物を、同じ温度で約2分間600rpmで攪拌しながらA1相中に乳化する。C相を、磁性攪拌しながら水中にトリエタノールアミンを溶解することによって室温で調製し、次いで上記混合物に約800rpmで加え、次いで冷却させる。D相をC相と同じ態様で調製し、50℃以下に冷却された該混合物に加える。次いで該組成物を、室温に冷却させる。

【0065】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0066】実施例6：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

A 1 相	
脱鈹物水	57.80%
防腐剤	0.25%
カーボマー	0.40%
グリセリン	3.00%
キサントガム	0.10%
A 2 相	
20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート (Polysorbate 60)	0.90%
B 相	
PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル	2.10%
セチルアルコール	2.60%
イソノナン酸イソノニル	11.00%
オクチルドデカノール	15.00%
ジオスゲニン	0.50%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
オクトクリレン	2.00%
防腐剤	0.15%
C 相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D 相	

脱鈹物水
防腐剤

【0067】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特

A 1 相

脱鈹物水

防腐剤

カーボマー

グリセリン

キサンタンゴム

A 2 相

20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート
(Polysorbate 60)

B 相

PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル

セチルアルコール

イソノナン酸イソノニル

オクチルドデカノール

ジオスゲニン

ブチルヒドロキシトルエン

カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド

防腐剤

C 相

脱鈹物水

トリエタノールアミン

D 相

脱鈹物水

防腐剤

【0069】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特

A 1 相

脱鈹物水

防腐剤

カーボマー

グリセリン

キサンタンゴム

A 2 相

20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート
(Polysorbate 60)

B 相

PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル

セチルアルコール

イソノナン酸イソノニル

オクチルドデカノール

1.50%

0.30%

にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0068】実施例7：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

66.70%

0.25%

0.40%

3.00%

0.10%

0.90%

2.10%

2.60%

6.00%

7.50%

0.10%

0.10%

6.00%

0.15%

2.00%

0.30%

1.50%

0.30%

にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0070】実施例8：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

66.70%

0.25%

0.40%

3.00%

0.10%

0.90%

2.10%

2.60%

6.00%

7.50%

ジオスゲニン	0.10%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
アンズ実油	6.00%
防腐剤	0.15%
C相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D相	
脱鈹物水	1.50%
防腐剤	0.30%

【0071】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特

にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0072】実施例9：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

A1相	
脱鈹物水	60.80%
防腐剤	0.25%
カーボマー	0.40%
グリセリン	3.00%
キサントガム	0.10%
A2相	
20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート (Polysorbate 60)	0.90%
B相	
PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル	2.10%
セチルアルコール	2.60%
イソノナン酸イソノニル	9.00%
オクチルドデカノール	10.00%
ジオスゲニン	0.50%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
メトキシケイ皮酸オクチル	6.00%
防腐剤	0.15%
C相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D相	
脱鈹物水	1.50%
防腐剤	0.30%

【0073】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特

にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0074】実施例10：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

A1相	
脱鈹物水	58.80%
防腐剤	0.25%
カーボマー	0.40%
グリセリン	3.00%
キサントガム	0.10%

A 2 相	
20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート (Polysorbate 60)	0.90%
B 相	
PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル	2.10%
セチルアルコール	2.60%
イソノナン酸イソノニル	7.00%
オクチルドデカノール	10.00%
ジオスゲニン	0.50%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
オクトクリレン	10.00%
防腐剤	0.15%
C 相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D 相	
脱鈹物水	1.50%
防腐剤	0.30%

【0075】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特

にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

【0076】実施例11：化粧品組成物

以下の組成物を、実施例5と同様の方法で調整した：

A 1 相	
脱鈹物水	63.30%
防腐剤	0.25%
カーボマー	0.40%
グリセリン	3.00%
キサントガム	0.10%
A 2 相	
20EOオキシエチレン化ソルビタンステアラート (Polysorbate 60)	0.90%
B 相	
PEG-100ステアラートとステアリン酸グリセリル	2.10%
セチルアルコール	2.60%
イソノナン酸イソノニル	11.50%
オクチルドデカノール	10.00%
ジオスゲニン	0.50%
ブチルヒドロキシトルエン	0.10%
メトキシケイ皮酸オクチル	1.00%
防腐剤	0.15%
C 相	
脱鈹物水	2.00%
トリエタノールアミン	0.30%
D 相	
脱鈹物水	1.50%
防腐剤	0.30%

【0077】得られた組成物の顕微鏡による観察により、エマルションは均一で均質であり、明確な境界を有し、結晶を含まないことが示される。さらに組成物の物

理化学的分析により、それは4℃、25℃及び45℃での二ヶ月間の貯蔵の後、安定であることが示される。特にジオスゲニンの再結晶化は、示された温度でのこの期

間の後に観察されない。さらに、HPLCによって測定 される、ジオスゲニンの化学的安定性は影響されない。

フロントページの続き

(72)発明者 フランシーヌ・バルドー
フランス・92330・ソー・リュ・ポール
クデルク・10・バティマン・エフ

(72)発明者 シュザンヌ・ドレー
フランス・95020・パリ・プラス・ドゥ
ラ・ボルト・ドゥ・バニョル・4